

特 許 協 力 条 約

P C T

国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条)
〔PCT36条及びPCT規則70〕

REC'D 13 MAY 2004

WIPO PCT

出願人又は代理人 の書類記号 3057W00P	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知（様式PCT/ IPEA/416）を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/07741	国際出願日 (日.月.年) 18.06.2003	優先日 (日.月.年) 19.06.2002
国際特許分類 (IPC) Int. C17A61K38/17, 31/7088, 39/395, 45/00, 48/00, A61P19/00, 19/02, 19/10, 29/00, 43/00 // C12N15/09		
出願人 (氏名又は名称) 武田薬品工業株式会社		

1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で <u>7</u> ページからなる。 <input type="checkbox"/> この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。 (PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照) この附属書類は、全部で <u> </u> ページである。
3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。 I <input checked="" type="checkbox"/> 国際予備審査報告の基礎 II <input type="checkbox"/> 優先権 III <input checked="" type="checkbox"/> 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 IV <input checked="" type="checkbox"/> 発明の単一性の欠如 V <input checked="" type="checkbox"/> PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 VI <input type="checkbox"/> ある種の引用文献 VII <input type="checkbox"/> 国際出願の不備 VIII <input checked="" type="checkbox"/> 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 24.07.2003	国際予備審査報告を作成した日 21.04.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 安川 聡	4C 3039
電話番号 03-3581-1101 内線 3452		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (1998年7月)

I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に
応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。
PCT規則70.16, 70.17)

☒ 出願時の国際出願書類

- | | | | | | |
|--------------------------|------------|---|-------|--------|----------------------|
| <input type="checkbox"/> | 明細書 | 第 | _____ | ページ、 | 出願時に提出されたもの |
| | 明細書 | 第 | _____ | ページ、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| | 明細書 | 第 | _____ | ページ、 | _____ 付の書簡と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> | 請求の範囲 | 第 | _____ | 項、 | 出願時に提出されたもの |
| | 請求の範囲 | 第 | _____ | 項、 | PCT19条の規定に基づき補正されたもの |
| | 請求の範囲 | 第 | _____ | 項、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| | 請求の範囲 | 第 | _____ | 項、 | _____ 付の書簡と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> | 図面 | 第 | _____ | ページ/図、 | 出願時に提出されたもの |
| | 図面 | 第 | _____ | ページ/図、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| | 図面 | 第 | _____ | ページ/図、 | _____ 付の書簡と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> | 明細書の配列表の部分 | 第 | _____ | ページ、 | 出願時に提出されたもの |
| | 明細書の配列表の部分 | 第 | _____ | ページ、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| | 明細書の配列表の部分 | 第 | _____ | ページ、 | _____ 付の書簡と共に提出されたもの |

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である _____ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 図面の第 _____ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

- ☒ 請求の範囲 16, 17

請求の範囲16, 17は、治療による人体の処置方法に関するものであって、PCT第34条(4)(a)(i)及びPCT規則67.1(iv)の規定により、この国際予備審査機関が国際予備審査を行うことを要しない対象に係るものである。

- ☐ 磁気ディスクによる配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

IV. 発明の単一性の欠如

1. 請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、

- ☐ 請求の範囲を減縮した。
- ☐ 追加手数料を納付した。
- ☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
- ☒ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。

2. ☐ 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規定に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
- ☒ 以下の理由により満足しない。

下記文献に記載のとおり、硫酸エステル加水分解酵素に対する阻害作用を有する化合物を骨・関節疾患の予防・治療に用いることは本願出願時に公知であるので、請求の範囲1-8, 11-15, 18に係る発明と、請求の範囲9, 10に係る発明の間に、同一又は対応する特別な技術的特徴を含む技術的な関係がないので、単一の一般的発明概念を形成するように連関している一群の発明には当たらない。

文献：WO 01/44268 A1 (STERIX LIMITED) 2001.06.21
WO 99/64013 A1 (STERIX LIMITED) 1999.12.06
WO 99/52890 A1 (NOVARTIS AG) 1999.10.21

4. したがって、この国際予備審査報告書を作成するに際して、国際出願の次の部分を、国際予備審査の対象にした。

- ☐ すべての部分
- ☒ 請求の範囲 1-8, 11-15, 18 に関する部分

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	1-8, 11-15, 18	有
	請求の範囲		無
進歩性 (IS)	請求の範囲		有
	請求の範囲	1-8, 11-15, 18	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-8, 11-15, 18	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献1 : WO 01/55411 A2 (MILLENNIUM PHARMACEUTICALS, INC.) 2001.08.02
文献2 : WO 01/44268 A1 (STERIX LIMITED) 2001.06.21
文献3 : WO 99/64013 A1 (STERIX LIMITED) 1999.12.16
文献4 : WO 99/52890 A1 (NOVARTIS AG) 1999.10.21

国際調査報告で引用された上記文献1には、本願配列番号: 1と同一のアミノ酸配列を有するタンパク質が記載されており (FIGURE5参照)、該タンパク質は、スルファターゼ関連疾患の診断や治療に有用であること (第36頁第8-12行参照)、スルファターゼと作用する物質をスクリーニングするために、該ポリペプチドを使用し得ること (第37頁第16行-第38頁第29行等参照)、該ポリペプチドに対する抗体をスルファターゼ活性阻害に関連する疾患の処置に使用できること (第49頁第3-5行等参照)、及び、該ポリペプチドをコードするポリヌクレオチドに対するアンチセンスヌクレオチドを設計できること (第58頁第12-13行等参照) などが記載されている。

同文献2には、ステロイドスルファターゼ活性を阻害し得る化合物が記載されており (Claim1参照)、該化合物が変形性関節症、慢性関節リウマチ、骨粗鬆症等の処置において有用であり得ることが示されている (第43頁第28行等参照)。

同文献3には、エストロンスルファターゼインヒビターとして使用できる化合物が記載されており (Claim4参照)、該化合物が変形性関節症、慢性関節リウマチ、骨粗鬆症等の処置において有用であり得ることが示されている (第38頁第31行等参照)。

同文献4には、ステロイドスルファターゼ阻害剤を、慢性関節リウマチの予防及び処置において使用することが記載されている (第14頁下4行-第15頁第8行参照)。

Ⅷ. 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付けについての意見を次に示す。

(1) 請求項 1-8, 11-15, 18

本願上記請求項には、「実質的に～」とあるが、この記載では、その範囲が不明確であり、PCT 6条における明確性の要件を欠いている。

(2) 請求の範囲 1, 2, 5, 18

本願上記請求の範囲には、配列番号：1で表されるアミノ酸配列を有するタンパク質等の活性を阻害する化合物、あるいは該タンパク質等の遺伝子の発現を阻害する化合物を有効成分とする骨・関節疾患の予防、治療剤が記載されている。

しかしながら、ある特定疾患において発現量が増加したタンパク質の活性や発現を阻害すれば、常に該疾患の予防、治療効果が奏されるとは限らないことが技術常識と認められるところ、本願明細書では、上記特性を有する化合物を用いた薬理試験等は何ら行われていないことから、上記特定の阻害作用を有する化合物が骨・関節疾患の予防、治療効果を有するとは直ちには認めることができない。

よって、本願上記請求項に係る発明は、PCT 5条の意味での開示を欠き、PCT 6条の意味での明細書の開示による裏付けを欠いている。

また、上記特定の阻害作用を有する化合物は、出願時の技術常識を勘案してもそのような性質を有する化合物の範囲を特定できないから、本願上記請求項に係る発明は、PCT 6条における明確性の要件も欠いている。

(3) 請求の範囲 3, 4

本願上記請求の範囲には、配列番号：1で表されるアミノ酸配列を有するタンパク質等をコードするポリヌクレオチドに対するアンチセンスヌクレオチド、あるいは、該タンパク質等に対する抗体を有効成分とする骨・関節疾患の予防、治療剤が記載されている。

しかしながら、本願明細書においては、上記有効成分を用いた薬理試験結果等は何ら示されておらず、(2)と同様の理由より、上記化合物が骨・関節疾患の予防、治療効果を有するとは直ちには認めることができない。

よって、本願上記請求項に係る発明は、PCT 5条の意味での開示を欠き、PCT 6条の意味での明細書の開示による裏付けを欠いている。

(4) 請求の範囲 11-14

本願上記請求の範囲には、配列番号：1で表されるアミノ酸配列を有するタンパク質等、又は該タンパク質をコードするポリヌクレオチドを用いた骨・関節疾患の予防、治療剤のスクリーニング方法あるいはスクリーニング用キットが記載されている。

しかしながら、(2)、(3)と同様の理由より、上記方法、あるいはキットにより、骨・関節疾患の予防、治療剤が得られるとは、直ちには認めることができない。

よって、本願上記請求項に係る発明は、PCT 5条の意味での開示を欠き、PCT 6条の意味での明細書の開示による裏付けを欠いている。

(5) 請求の範囲 15

本願上記請求の範囲に記載の予防、治療剤は、請求項 11-14のスクリーニング方法、あるいはキットを用いて得られるあらゆる予防、治療剤を包含するものであるが、本願明細書においては、当該方法で得られた予防、治療剤としての具体的なものが一切記載されていないから、本願上記請求項に係る発明は、PCT 5条の意味での開示を欠き、PCT 6条の意味での明細書の開示による裏付けを欠いている。

また、本願出願時の技術常識を勘案しても、具体的にどのようなものが包含されるか不明確であり、本願上記請求項に係る発明は、PCT 6条における明確性の要件も欠いている。

補充欄 (いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること)

第 V 欄の続き

○請求の範囲 1-8, 11-15, 18

請求の範囲 1-8, 11-15, 18 に記載された発明は、上記文献 1-4 に記載されておらず、新規性を有する。

本願上記請求の範囲に係る発明と、上記文献 1 に記載された発明とを比較すると、有効成分を適用する疾患が、本願上記請求の範囲に係る発明においては、骨・関節疾患に特定されているのに対し、上記文献 1 に記載された発明においては、「スルファターゼ関連疾患」とあるのみで、骨・関節疾患に適用することが明示されていない点で相違する。

しかしながら文献 2-4 には、スルファターゼ活性を阻害する化合物を、変形性関節症、慢性関節リウマチ、骨粗鬆症等の骨・関節疾患に適用し得ることが記載されており、この記載より、骨・関節疾患を「スルファターゼ関連疾患」と考え、文献 1 に記載の発明において、上記骨・関節疾患に対して有効成分を適用することは、当業者が容易になし得た事項と認められる。

そして、その効果が格別であるとも認められない。

したがって、請求の範囲 1-8, 11-15, 18 に記載された発明は、上記文献 1-4 に対して進歩性を有さない。